

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2000年12月28日 (28.12.2000)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 00/78716 A1(51) 国際特許分類: C07D 209/16,
209/44, 211/14, 215/42, 401/04, 401/12, 401/14, 405/04,
413/04, A61K 31/4525, 31/454, A61P 43/00, 9/00, A61K
31/4545, 31/4709, A61P 9/12, A61K 31/4725, 31/496

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/04068

(22) 国際出願日: 2000年6月22日 (22.06.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

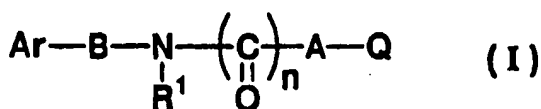
(30) 優先権データ:
特願平11/178170 1999年6月24日 (24.06.1999) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 東レ株式
会社 (TORAY INDUSTRIES, INC.) [JP/JP]; 〒103-8666
東京都中央区日本橋室町2丁目2番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 林 亮司

(HAYASHI, Ryoji) [JP/JP]; 〒251-0033 神奈川県藤沢
市片瀬山3-13-9 Kanagawa (JP). 大森英爾 (OHMORI,
Eiji) [JP/JP]; 〒520-0842 滋賀県大津市園山2-15-1
Shiga (JP). 磯ヶ谷昌文 (ISOGAYA, Masafumi) [JP/JP];
〒245-0016 神奈川県横浜市泉区和泉町3989-7 Kana-
gawa (JP). 森脇光博 (MORIWAKI, Mitsuhiro) [JP/JP];
〒248-0036 神奈川県鎌倉市手広1111 Kanagawa (JP).
熊谷洋紀 (KUMAGAI, Hiroki) [JP/JP]; 〒248-0034 神
奈川県鎌倉市津西2-1-20 L-302 Kanagawa (JP).

(81) 指定国 (国内): AU, CA, CN, JP, KR, US.

(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE,
DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).添付公開書類:
— 国際調査報告書2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。(54) Title: α_{1B} -ADRENERGIC RECEPTOR ANTAGONISTS(54) 発明の名称: アドレナリン α_{1B} 受容体拮抗薬

is 0, 1 or the like; A is trimethylene, butylene, or the like; and Q is piperidine, isoindoline, or the like]. The compounds and the salts serve as antagonists having a high affinity for α_{1B} -adrenergic receptor and are useful as drugs to be used in the prevention and/or treatment of α_{1B} -adrenergic receptor-related diseases (such as hypertension) or as pharmacological tools for the elucidation of physiologic actions occurring through α_{1B} -adrenergic receptor.

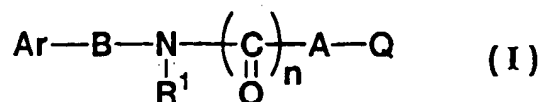
(57) Abstract: Compounds of the general formula (I) or pharmacologically acceptable acid addition salts thereof; and α_{1B} -adrenergic receptor antagonists comprising the compounds or the salts: [wherein Ar is indole or the like; R¹ is hydrogen or the like; B is a bond or B-N-R¹ may form a ring structure such as piperidine; n

[続葉有]

WO 00/78716 A1

請求の範囲

1. 一般式 (I)



[式中、Arは、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数1～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているインドール、ナフタレン、キノリン、ベンズイミダゾール、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ベンゾイソオキサゾール、または2-ケトベンズイミダゾリンを表し、

R¹は、水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数6～12のアリール、炭素数2～9のアルケニル、または炭素数3～8のシクロアルキルを表し、

Bは、価標、無置換もしくは炭素数1～8のアルキル基、ハロゲン、ヒドロキシから選ばれる基で置換されている炭素数1～3のアルキレン、

またはB-N-R¹が環構造を形成し、無置換もしくはハロゲン、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、炭素数2～9のアルキルカルボニル基、炭素数7～16のアリールカルボニル基、炭素数7～15のアラルキル基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピペラジン、または2,3,6-トリヒドロピリジ

ンを表し、

nは0または1の整数を表し、

Aは、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されている炭素数2～8のアルキレン、フェニレン、または炭素数3～8のシクロアルキレンを表し、

Qは、

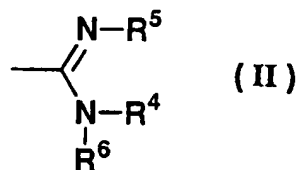
1) $-NR^2R^3$ 、

ここで R^2 、 R^3 は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリールまたは炭素数7～15のアラルキル（アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい）

または $-NR^2R^3$ がいっしょになって、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素

数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピロリジン、1,3,4-トリヒドロイソキノリン、イソインドリン、ピペラジン、モルホリン、2-ピペリドン、2-ピロリドン、インドリン、2,3,4-トリヒドロキノリン、2,3,4-トリヒドロキノキサリン、ジヒドロベンゾオキサジン、ベンゾチアン、フタルイミド、またはグアニジン、または

2) 式(II)



(式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリールまたは炭素数7～15のアラルキル(アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアリールアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい)、または R^4 、 R^5 が一緒になってイミダゾリン環を形成する)を表す]で示される化合物、またはその薬

理学的に許容される酸付加塩からなるアドレナリン α 1 B 受容体拮抗薬。

2. 一般式 (I) において、 n が 0 であり、

A_r が、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数 1～9 のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 6～15 のアリールアミノ基、炭素数 2～16 のジアルキルアミノ基、炭素数 12～20 のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 6～15 のアリール基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、炭素数 6～15 のアリールオキシ基、炭素数 1～8 のハロアルキル基、炭素数 1～8 のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数 0～15 のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数 2～9 のアルコキシカルボニル基、炭素数 1～15 のアミノカルボニル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 6～15 のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているインドール、ナフタレン、キノリン、ベンズイミダゾール、ベンゾフラン、またはベンゾチオフェンであり、

B が、無置換もしくは炭素数 1～8 のアルキル基、ハロゲン、ヒドロキシから選ばれる基で置換されている炭素数 2～3 のアルキレン、または $B-N-R^1$ が環構造を形成し、無置換もしくはハロゲン、ヒドロキシ、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 6～15 のアリール基、炭素数 1～8 のハロアルキル基、炭素数 0～15 のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数 2～9 のアルコキシカルボニル基、炭素数 1～15 のアミノカルボニル基、炭素数 1～8 のヒドロキシアルキル基、炭素数 2～9 のアルキルカルボニル基、炭素数 7～16 のアリールカルボニル基、炭素数 7～15 のアラルキル基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピペラジン、または 2,3,6-トリヒドロピリジンであり、

A が請求項 1 の定義に同じであり、

Q が、

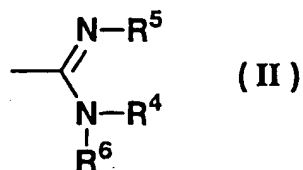
1) $-NR^2R^3$ 、

ここで R^2 、 R^3 は、独立して水素、炭素数 1～6 のアルキル、炭素数 3～8 のシクロアルキル、炭素数 2～9 のアルケニル、炭素数 6～15 のアリール、または炭素数 7～15 のアラルキル（アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロ

ゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい）、

または、 $-NR^2R^3$ がいっしょになって、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピロリジン、1,3,4-トリヒドロイソキノリン、イソインドリン、ピペラジン、モルホリン、インドリン、2,3,4-トリヒドロキノリン、2,3,4-トリヒドロキノキサリン、ジヒドロベンゾオキサジン、またはグアニジン、または、

2) 式 (II)



(ここで R^4 、 R^5 、 R^6 は請求項1で定義した通り)を表す、である請求項1記載のアドレナリン α 1B受容体拮抗薬。

3. 一般式 (I) において、nが0であり、

Arが、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているインドール、ナフタレン、キノリン、またはベンズイミダゾールであり、

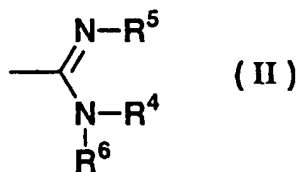
B-N-R¹が環構造を形成して、無置換もしくはハロゲン、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、炭素数2～9のアルキルカルボニル基、炭素数7～16のアリールカルボニル基、炭素数7～15のアラルキル基から選ばれる基で置換されているピペリジンまたはピペラジンであり、

Aが、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されている炭素数2～8のアルキレンまたは炭素数3～8のシクロアルキレンであり、

Qが

1) $-NR^2R^3$ (ここで R^2 、 R^3 は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリール、または炭素数7～15のアラルキル(アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい)、または $-NR^2R^3$ がいっしょになって、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピロリジン、1,3,4-トリヒドロイソキノリン、イソインドリン、ピペラジン、モルホリン、またはグアニジン、または

2) 式(II)



(ここで R^4 、 R^5 、 R^6 は請求項1で定義した通り)を表す、である請求項1また

は2のいずれか1項記載のアドレナリン α 1B受容体拮抗薬。

4. 一般式(I)において、nが0であり、

Arが、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1~9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1~8のアルキルアミノ基、炭素数6~15のアリールアミノ基、炭素数2~16のジアルキルアミノ基、炭素数12~20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1~8のアルキル基、炭素数6~15のアリール基、炭素数1~8のアルコキシ基、炭素数6~15のアリールオキシ基、炭素数1~8のハロアルキル基、炭素数1~8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0~15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2~9のアルコキシカルボニル基、炭素数1~15のアミノカルボニル基、炭素数1~8のアルキルチオ基、炭素数6~15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているインドールまたはナフタレンであり、

B-N-R¹が環構造を形成して、無置換もしくはハロゲン、ヒドロキシ、炭素数1~8のアルキル基、炭素数6~15のアリール基、炭素数1~8のハロアルキル基、炭素数0~15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2~9のアルコキシカルボニル基、炭素数1~15のアミノカルボニル基、炭素数1~8のヒドロキシアルキル基、炭素数2~9のアルキルカルボニル基、炭素数7~16のアリールカルボニル基、炭素数7~15のアラルキル基から選ばれる基で置換されている下式1)または2)であり、



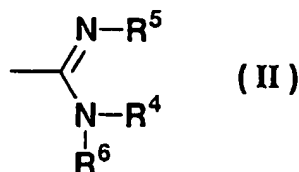
Aが、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1~9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1~8のアルキルアミノ基、炭素数6~15のアリールアミノ基、炭素数2~16のジアルキルアミノ基、炭素数12~20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1~8のアルキル基、炭素数6~15のアリール基、炭素数1~8のアルコキシ基、炭素数6~15のアリールオキシ基、炭素数1~8のハロアルキル基、炭素数1~8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0~1

5のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されている炭素数3～8のアルキレンであり、

Qが

1) $-NR^2R^3$ (ここで R^2 、 R^3 は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリール、または炭素数7～15のアラルキル(アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい)、または $-NR^2R^3$ がいっしょになって、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピロリジン、1,3,4-トリヒドロイソキノリン、イソインドリン、ピペラジン、モルホリン、またはグアニジン、または

2) 式(I I)

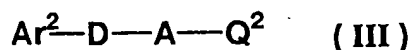


(ここで R^4 、 R^5 、 R^6 は請求項1で定義した通り)である、請求項1～3のいずれか1項記載のアドレナリン α 1B受容体拮抗薬。

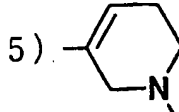
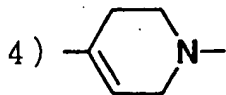
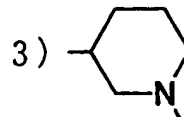
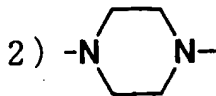
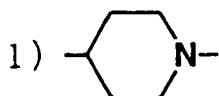
5. 請求項1記載の一般式(I)で示される化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩を有効成分とする循環器系疾患治療剤。

6. 請求項1記載の一般式(I)で示される化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩を有効成分とする高血圧治療剤。

7. 一般式(III)



[式中、Dは、無置換もしくはハロゲン、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、炭素数2～9のアルキルカルボニル基、炭素数7～16のアリールカルボニル基、炭素数7～15のアラルキル基から選ばれる基で置換されている下式1)～5)を表し、



Ar^2 は、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、

アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているインドール、ナフタレン、キノリン、ベンズイミダゾール、ベンゾフラン、またはベンゾチオフェンを表し、

Aは、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されている炭素数3～8のアルキレン、フェニレン、または炭素数3～8のシクロアルキレンを表し、

Q²は

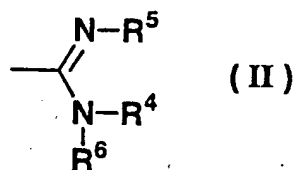
1) $-NR^2R^3$ 、

ここでR²、R³は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリール、または炭素数7～15のアラルキル（アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基

、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい。ただし、 $R^2 = R^3 = H$ 、 $R^2 = R^3 = \text{エチル}$ は除く）、

または、 $-NR^2R^3$ がいっしょになって、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピロリジン、1,3,4-トリヒドロイソキノリン、イソインドリン、ピペラジン、モルホリン、2-ピペリドン、2-ピロリドン、インドリン、2,3,4-トリヒドロキノリン、2,3,4-トリヒドロキノキサリン、ジヒドロベンゾオキサジン、またはグアニジン、または

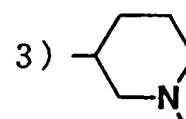
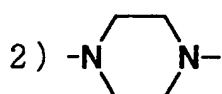
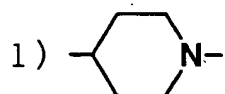
2) 式 (II)



(式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリール、または炭素数7～15のアラルキル（アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16の

ジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい)、または R^4 、 R^5 がいっしょになってイミダゾリン環を形成する)を表す]で示される化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

8. 一般式(III)において、Dが、無置換もしくはハロゲン、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、炭素数2～9のアルキルカルボニル基、炭素数7～16のアリールカルボニル基、炭素数7～15のアラルキル基から選ばれる基で置換されている下式1)～3)であり、



Ar^2 が、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているインドール

、ナフタレン、キノリン、またはベンズイミダゾールであり、

Aが、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されている炭素数3～8のアルキレンまたは炭素数3～8のシクロアルキレンであり、

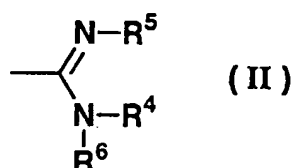
Q^2 が

1) $-NR^2R^3$ 、

ここで R^2 、 R^3 は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリール、または炭素数7～15のアラルキル（アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい。ただし、 $R^2=R^3=H$ 、 $R^2=R^3=$ エチルは除く）、または $-NR^2R^3$ がいっしょになって、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ基、炭素

数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピロリジン、1,3,4-トリヒドロイソキノリン、イソインドリン、ピペラジン、モルホリン、インドリン、2,3,4-トリヒドロキノリン、2,3,4-トリヒドロキノキサリン、ジヒドロベンゾオキサジン、またはグアニジン、または

2) 式 (II)



(式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 は請求項7で定義した通り)である請求項7記載の化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

9. 一般式 (III) において、Dが、無置換もしくはハロゲン、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシル基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のヒドロキシアルキル基、炭素数2～9のアルキルカルボニル基、炭素数7～16のアリールカルボニル基、炭素数7～15のアラルキル基から選ばれる基で置換されている下式1)～2)であり、



Ar^2 が、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ

基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているインドールまたはナフタレンであり、

Aが、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数2～9のアルコキシカルボニル基、炭素数1～15のアミノカルボニル基、炭素数1～8のアルキルチオ基、炭素数6～15のアリールチオ基から選ばれる基で置換されている炭素数3～8のアルキレンであり、

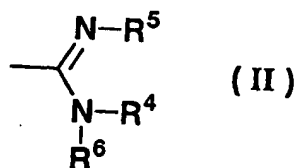
Q^2 が

1) $-NR^2R^3$ 、

ここで R^2 、 R^3 は、独立して水素、炭素数1～6のアルキル、炭素数3～8のシクロアルキル、炭素数2～9のアルケニル、炭素数6～15のアリール、または炭素数7～15のアラルキル（アリール、アラルキルのアリール部分は、ハロゲン、ニトロ基、炭素数1～9のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数1～8のアルキルアミノ基、炭素数6～15のアリールアミノ基、炭素数2～16のジアルキルアミノ基、炭素数12～20のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数1～8のアルキル基、炭素数6～15のアリール基、炭素数1～8のアルコキシ基、炭素数6～15のアリールオキシ基、炭素数1～8のハロアルキル基、炭素数1～8のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数0～15のアミノスルホニル基、

カルボキシ基、炭素数 2～9 のアルコキシカルボニル基、炭素数 1～15 のアミノカルボニル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 6～15 のアリールチオ基から選ばれる基で置換されていてもよい。ただし、 $R^2 = R^3 = H$ 、 $R^2 = R^3 = \text{エチル}$ は除く)、または $-NR^2R^3$ がいっしょになって、無置換もしくはハロゲン、ニトロ基、炭素数 1～9 のアシルアミノ基、アミノ基、炭素数 1～8 のアルキルアミノ基、炭素数 6～15 のアリールアミノ基、炭素数 2～16 のジアルキルアミノ基、炭素数 12～20 のジアリールアミノ基、ヒドロキシ、炭素数 1～8 のアルキル基、炭素数 6～15 のアリール基、炭素数 1～8 のアルコキシ基、炭素数 6～15 のアリールオキシ基、炭素数 1～8 のハロアルキル基、炭素数 1～8 のハロアルコキシ基、シアノ基、炭素数 0～15 のアミノスルホニル基、カルボキシ基、炭素数 2～9 のアルコキシカルボニル基、炭素数 1～15 のアミノカルボニル基、炭素数 1～8 のアルキルチオ基、炭素数 6～15 のアリールチオ基から選ばれる基で置換されているピペリジン、ピロリジン、1,3,4-トリヒドロイソキノリン、イソインドリン、ピペラジン、モルホリン、またはグアニジン、または

2) 式 (II)



(式中、 R^4 、 R^5 、 R^6 は請求項 7 で定義した通り)である、請求項 7 または 8 いずれか 1 項記載の化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩。

10. 請求項 7 記載の一般式 (III) で示される化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなる医薬。

11. 請求項 7 記載の一般式 (III) で示される化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩からなるアドレナリン $\alpha 1 B$ 受容体拮抗薬。

12. 請求項7記載の一般式(III)で示される化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩を有効成分とする。循環器系疾患治療剤。

13. 請求項7記載の一般式(III)で示される化合物、またはその薬理学的に許容される酸付加塩を有効成分とする高血圧治療剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/04068

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D209/16, 44, 211/14, 215/42, 401/04, 12, 14, 405/04, 413/04,
A61K31/4525, 454, 4545, 4709, 4725, 496, A61P43/00, 9/00, 9/12

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D209/16, 44, 211/14, 215/42, 401/04, 12, 14, 405/04, 413/04,
A61K31/4525, 454, 4545, 4709, 4725, 496, A61P43/00, 9/00, 9/12

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CA, REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| X | WO, 99/20621, A1 (ELI LILLY AND COMPANY), 24 April, 1999 (24.04.99), Full text, & AU, 9911931, A | 1-13 |
| X | US, 5296497, A (DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B.V.), 22 March, 1994 (22.03.94), Full text (Family: none) | 1-13 |
| X | EP, 398413, A1 (DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B.V.), 22 November, 1990 (22.11.90), Full text, & CA, 2016625, A & AU, 9054944, A & ZA, 9003626, A & JP, 3-17058, A | 1-13 |
| X | EP, 434561, A2 (ADIR ET CIE.), 26 June, 1991 (26.06.91), Claims etc. & FR, 2655988, A & ZA, 9009767, A & CA, 2032713, A & AU, 9068235, A & JP, 3-291275, A & US, 5143916, A & US, 5166157, A & US, 5162324, A | 1, 5, 6 |

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
16 August, 2000 (16.08.00)

Date of mailing of the international search report
29 August, 2000 (29.08.00)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/04068

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| | & US, 5166156, A | |
| X | WO, 92/15301, A1 (LUNDBECK H. A/S), 17 September, 1992 (17.09.92), Full text, & JP, 5-505612, A | 1, 5, 6, 7, 10-13 |
| X | JP, 56-53654, A (SUMITOMO CHEMICAL CO. LTD.), 13 May, 1981 (13.05.81), Full text (Family: none) | 1, 5, 6 |
| X | JP, 50-108264, A (SUMITOMO CHEMICAL CO. LTD.), 26 August, 1975 (26.08.75), Full text (Family: none) | 1, 5, 6 |
| X | GB, 1047935, A (AMERICAN CYANAMID CO.), 09 November, 1966 (09.11.66), Full text, & BE, 637271, A & NL, 297170, A | 7, 8, 10 |
| X | Chemical Abstracts, vol.63, column 13290, Par. h to column 13291, Par. g | 7, 8 |
| X | Chemical Abstracts, vol.62, column 12339, Par. b-c | 7, 8, 10 |
| X | US, 3331843, A (AMERICAN CYANAMID CO.), 18 July, 1967 (18.07.67), Full text (Family: none) | 7, 8, 10 |
| X | EP, 735024, A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY), 02 October, 1996 (02.10.96), Full text, & US, 5472966, A & CA, 2171782, A & AU, 9650332, A & JP, 8-277267, A | 1-30 |
| X | EP, 732332, A1 (HOECHST MARION ROUSSEL INC.), 18 September, 1996 (18.09.96), Full text, & CA, 2171695, A & AU, 9648113, A & NO, 9601077, A & CN, 1139108, A & JP, 9-3060, A & US, 5801176, A | 7, 8, 10 |
| X | WO, 95/17182, A1 (ELI LILLY AND COMPANY), 29 June, 1995 (29.06.95), production example 6 etc. & US, 5545636, A & CA, 2179650, A & AU, 9513398, A & JP, 9-507066, A & EP, 817627, A1 & ZA, 9410139, A & US, 5661173, A & US, 5668152, A & US, 5672618, A | 7-9 |
| X | SRIVASTAVA Sandhya et al., "Synthesis of 7-chloro-4-substituted aminoquinolines and their in vitro ability to produce methemoglobin in canine hemolyzate", Bioorg.Med.Chem.Lett., (1997), 7(21), pp.2741-6 | 7, 8, 10 |
| X | WO, 98/38189, A1 (MERCK PATENT G.M.B.H.), 03 September, 1998 (03.09.98), BEISPIEL 2 etc. & DE, 19707628, A & AU, 9863949, A | 7-9 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP00/04068

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|-----------|---|-----------------------|
| | & EP, 964863, A1 & BR, 9807765, A & ZA, 9801579, A & NO, 9904106, A | |
| PX | WO, 99/55695, A1 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORP.), 04 November, 1999 (04.11.99), Full text, & AU, 9939670, A | 1-13 |
| PX | US, 6066637, A (AMERICAN HOME PRODUCTS CORP.), 23 May, 2000 (23.05.00), Full text (Family: none) | 1-13 |

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/16, 44, 211/14, 215/42, 401/04, 12, 14, 405/04, 413/04,
A61K31/4525, 454, 4545, 4709, 4725, 496, A61P43/00, 9/00, 9/12

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D209/16, 44, 211/14, 215/42, 401/04, 12, 14, 405/04, 413/04,
A61K31/4525, 454, 4545, 4709, 4725, 496, A61P43/00, 9/00, 9/12

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA, REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
|-----------------|---|------------------|
| X | WO, 99/20621, A1 (ELI LILLY AND COMPANY), 2 9. 4月. 1999 (24. 04. 99), 全文& AU, 9911931, A | 1-13 |
| X | US, 5296497, A (DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B. V.), 22. 3月. 1994 (22. 03. 94), 全文 (ファミリーなし) | 1-13 |

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

16. 08. 00

国際調査報告の発送日

29.08.00

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富永 保

4P

9159

電話番号 03-3581-1101 内線 3490

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|---|-------------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X | EP, 398413, A1 (DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B. V.), 22. 11月. 1990 (22. 11. 90), 全文& CA, 2016625, A&AU, 9054944, A& ZA, 9003626, A&JP, 3-17058, A | 1-13 |
| X | EP, 434561, A2 (ADIR ET CIE.), 26. 6月. 1991 (26. 06. 91), 請求の範囲等& FR, 2655988, A&ZA, 9009767, A& CA, 2032713, A&AU, 9068235, A& JP, 3-291275, A&US, 5143916, A& US, 5166157, A&US, 5162324, A& US, 5166156, A | 1, 5, 6 |
| X | WO, 92/15301, A1 (LUNDBECK H. A/S), 17. 9月. 1992 (17. 09. 92), 全文& JP, 5-505612, A | 1, 5, 6, 7, 10-13 |
| X | JP, 56-53654, A (SUMITOMO CHEMICAL CO. LTD.); 13. 5月. 1981 (13. 05. 81), 全文 (ファミリーなし) | 1, 5, 6 |
| X | JP, 50-108264, A (SUMITOMO CHEMICAL CO. LTD.), 26. 8月. 1975 (26. 08. 75), 全文 (ファミリーなし) | 1, 5, 6 |
| X | GB, 1047935, A (AMERICAN CYANAMID CO.), 9. 11月. 1966 (09. 11. 66), 全文& BE, 637271, A&NL, 297170, A | 7, 8, 10 |
| X | Chemical Abstracts, vol. 63, 13290欄h段-13291欄g段 | 7, 8 |
| X | Chemical Abstracts, vol. 62, 12339欄b-c段 | 7, 8, 10 |
| X | US, 3331843, A (AMERICAN CYANAMID CO.), 18. 7月. 1967 (18. 07. 67), 全文 (ファミリーなし) | 7, 8, 10 |
| X | EP, 735024, A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY), 2. 10月. 1996 (02. 10. 96), 全文& US, 5472966, A&CA, 2171782, A& AU, 9650332, A&JP, 8-277267, A | 1-30 |

| C (続き) . 関連すると認められる文献 | | |
|-----------------------|--|------------------|
| 引用文献の カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示 | 関連する 請求の範囲の番号 |
| X | EP, 732332, A1 (HOECHST MARION ROUSSEL INC.), 1 8. 9月. 1996 (18. 09. 96), 全文& CA, 2171695, A&AU, 9648113, A& NO, 9601077, A&CN, 1139108, A& JP, 9-3060, A&US, 5801176, A | 7, 8, 10 |
| X | WO, 95/17182, A1 (ELI LILLY AND COMPANY), 2 9. 6月. 1995 (29. 06. 95), 製造例6等& US, 5545636, A&CA, 2179650, A& AU, 9513398, A&JP, 9-507066, A& EP, 817627, A1&ZA, 9410139, A& US, 5661173, A&US, 5668152, A& US, 5672618, A | 7-9 |
| X | SRIVASTAVA Sandhya et al., "Synthesis of 7-chloro-4- substituted aminoquinolines and their in vitro ability to produce methemoglobin in canine hemolyzate", Bioorg. Med. Chem. Lett., (1997), 7(21), p. 2741-6 | 7, 8, 10 |
| X | WO, 98/38189, A1 (MERCK PATENT G.M.B.H.), 3. 9月. 1998 (03. 09. 98), BEISPIEL 2 etc. & DE, 19707628, A&AU, 9863949, A& EP, 964863, A1&BR, 9807765, A& ZA, 9801579, A&NO, 9904106, A | 7-9 |
| PX | WO, 99/55695, A1 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORP.), 4. 11月. 1999 (04. 11. 99), 全文& AU, 9939670, A | 1-13 |
| PX | US, 6066637, A (AMERICAN HOME PRODUCTS CORP.), 2 3. 5月. 2000 (23. 05. 00), 全文 (ファミリーな し) | 1-13 |